

 補正却下 昭和 48年特許第666443号 07/10/30		⑩ 日本国特許庁 公開特許公報	
<p>第 1 号</p> <p>(200円) 特許許可</p> <p>特許庁長官 指定する特許出願人</p> <p>1. 発明の名称 プロピニルメルカブト誘導体の製造法</p> <p>2. 原特許出願の表示 昭和45年特許出願第1147756号 (昭和47年10月30日特許庁審査部提出)</p> <p>発明者 住 所 神奈川県平塚市中原上谷1006</p> <p>氏名 青角二雄 外2名</p> <p>特許出願人 住 所 東京都中央区京橋2丁目9番地</p> <p>(609) 名称 前田義典株式会社</p> <p>代理人 代表者 中川 連 住所 〒105 東京都港区西新橋1丁目2番9号 三井物産館内 電話(551)0261番</p> <p>(2400) 氏名 金丸清男 外2名</p>		<p>①特開昭 49-102616</p> <p>④公開日 昭49.(1974)9.27</p> <p>②特願昭 48-17888</p> <p>③出願日 昭47.(1972)10.30</p> <p>審査請求 未請求 (全3頁)</p> <p>⑤日本分類</p> <p>6664 43 16 B661 7043 44 30 B4</p>	
<p>明細書</p> <p>1. 発明の名称 プロピニルメルカブト誘導体の製造法</p> <p>2. 特許請求の範囲</p> <p>一般式</p> $B_1 C \equiv C C H X$ <p>(式中 B_1 および B_2 は水素原子または低級アルキル基を示し、X はハロゲン原子を示す) で表わされるプロピニルヘロゲン誘導体に</p> <p>一般式</p> $H S C H C O O H$ <p>(式中 R_1 は水素原子または低級アルキル基を示す) で表わされるメルカブト誘導体又はこれの塩の存在下に又は不存在下に反応させることを特徴とする。一般式</p> $B_1 C \equiv C C H S C H C O O H$ <p>(式中 B_1 , R_1 および R_2 は、前述したものと同様</p> <p>3. 発明の詳細な説明 本発明は一般式</p> $R_1 C \equiv C C H S C H C O O H$ <p>(式中 R_1 , R_2 , B_1 は水素原子または低級アルキル基を示す) で表わされる新規なプロピニルメルカブト誘導体又はこれの塩の製造法に関するものである。</p> <p>本発明の方法によつて製造される一般式(I)で示されるプロピニルメルカブト誘導体は、文献未記載の新規な化合物であるつて抗炎症作用を有する有用なものであり、かつ医薬品合成の中間体としても極めて有用である。</p> <p>本発明の方法によれば、前記(I)式を有するプロピニルメルカブト誘導体又はこれの塩は、</p> <p>一般式</p> $R_1 C \equiv C C H X$ <p>(式中 R_1 , R_2 , B_1 および B_2 は、前述したものと同様</p>			

〔式中 R_1 および R_2 は、前述したものと同様を示し、Xはハロゲン原子、特に臭素又は塩素原子を示す〕で表わされるプロピニルハロゲン誘導体純一式。



〔式中 R_1 は、前述したものと同様を示す〕で表わされるメルカブト誘導体又はこれの塩を塩基の存在下に又は不存在下に反応させることによつて製造される。本発明の方法を実施するに当つては、アルカリ水溶液またはアルコラート中、塩酸で約30時間反応を行うのが適当である。反応終了後、反応液を蒸留して酸性とし、有機溶媒で抽出する。溶媒を除去し、被審物を減圧蒸留または再結晶するなどの精製により遮離酸の形の目的生成物が得取できる。塩基としては例えば水酸化アルカリ、アルカリ、アルコラート、醇母級アミン等が用い得る。反応剤 (II) 及び生成物 (I) の塩は、例えばアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩、その他の上記反応並びに生理的に無害な塩であり

ルギルプロマイドナノナと水酸化ナトリウム80gを水100mlに溶かした溶液を実施例1に準じて処理する。減圧蒸留すると沸点109~116°C/1mm Hg の2-(2-プロピニルメルカブト)プロピオン酸ナノナが得られる。冷却すると融点120~123°Cの結晶となる。

実施例3

メルカブト酢酸ナノナと2-ブロモエーノーブテン60gと水酸化ナトリウム30gを水600mlに溶かした溶液を実施例1に準じて処理する。減圧蒸留すると沸点98~103°C/1mm Hg の2-メチル-2-ブロピニルメルカブト酢酸ナノナが得られる。

実施例4

メルカブト酢酸ナノナとノブロモエーノーブテン20gと水酸化ナトリウムエヌガラスを水150mlに溶かした溶液を実施例1に準じて処理する。減圧蒸留すると沸点117~120°C/0.4mm Hg の2-メチル-2-ブロピニルメルカブト酢酸ナノナが得られる。

特開昭49-102618(2)

特許。

本発明の方法に使用される出発物質である一般式(I)のプロピニルハロゲン誘導体は文献既知の方法で合成することができます。

次に本発明の方法を実施例により具体的に説明するが、本発明はこれにより限定されるものではない。

実施例1

メルカブト酢酸100gを水酸化ナトリウム80gと水100mlの混合液に加え、30分間かきまぜる。この溶液にプロパルギル・プロマイドナノナを滴下し、反応液を室温で30時間かきまぜる。次に稀硫酸を加えてpH2~3とし、エーテル抽出する。抽出液を乾燥後、沪過し、沪液を濃縮する。被審物を減圧蒸留すれば沸点110~113°C/2mm Hg の2-ブロピニルメルカブト酢酸ナノナが得られる。このものは冷却すると融点120~121°Cの結晶となる。

実施例2

2-メルカブトプロピオン酸100g、ブロバ

試験物

本発明の方法で製造された式(I)の化合物が抗炎作用をもつことを例証するために、抗炎症作用の有無を示す尺度として、カラグメンによつて惹起される浮腫を抑制する効果を調べた。この目的で下記の供試化合物について3mg/ラット皮内膜腔内投与におけるカラグメン浮腫抑制率を常法で測定した。その結果を次表に示す。

供試化合物	抑制率%
2-ブロピニルメルカブト酢酸	27.8
2-(2-ブロピニルメルカブト)プロピオン酸	33.2
2-メチル-2-ブロピニルメルカブト酢酸	22.8
2-メチル-2-ブロピニルメルカブト酢酸	38.0

特許昭49-182616(2)

6.添付書類の目録

- | | |
|---------|----|
| (1)明細書 | 1通 |
| (2)図面 | 1通 |
| (3)委任状 | 1通 |
| (4)願書副本 | 1通 |

審査を受ける
本件に係る書類

7.前記以外の掲明者、代理人

(1)発明者

住所 東京都文京区白山4-67-14

氏名 伊藤 定一郎

住所 神奈川県横浜市港北区仲木原2-5-12

氏名 佐藤 喬正

(2)代理人

住所 東京都港区西新橋1丁目2番9号
三井物産館内

氏名 朝内 忠夫

同所 八木田一義

同所 浜野 孝雄

同所 泰田 一哲














































































































































































































































































































